

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005年9月1日 (01.09.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/080322 A1(51) 国際特許分類: C07C 279/22, A61K 31/166,
31/343, 31/351, 31/352, 31/357, 31/385, 31/41, 31/4168,
31/4196, 31/421, 31/426, 31/438, A61P 25/06, 43/00,
C07D 221/20, 233/88, 249/08, 257/04, 263/28, 277/18,
277/28, 307/94, 309/06, 309/22, 311/96, 317/72, 339/06

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/002950

(22) 国際出願日: 2005年2月17日 (17.02.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2004-044122 2004年2月20日 (20.02.2004) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 山之内
製薬株式会社 (YAMANOUCHI PHARMACEUTICAL
CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本
町二丁目3番11号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 山田 弘美 (YA-
MADA, Hiroyoshi) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市
御幸が丘2-1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 板鼻
弘恒 (ITAHANA, Hirotsune) [JP/JP]; 〒1748612 東京都
板橋区蓮根三丁目17番1号 山之内製薬株式会社内
Tokyo (JP). 森友 紋子 (MORITOMO, Ayako) [JP/JP];
〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘2-1 山之内製
薬株式会社内 Ibaraki (JP). 松澤 崇穂 (MATSUZAWA,
Takaho) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘
2-1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 原田 幸一郎
(HARADA, Koichiro) [JP/JP]; 〒7141401 岡山県小田郡
美星町大字明治1389-2 Okayama (JP). 藤安 次
郎 (FUJIIYASU, Jiro) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば
市御幸が丘2-1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP).
古賀 祐司 (KOGA, Yuji) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つ
くば市御幸が丘2-1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki(JP). 奥誠 (OKU, Makoto) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つ
くば市御幸が丘2-1 山之内製薬株式会社内 Ibaraki
(JP). 岡崎 利夫 (OKAZAKI, Toshio) [JP/JP]; 〒3058585
茨城県つくば市御幸が丘2-1 山之内製薬株式会社内
Ibaraki (JP). 阿久沢 忍 (AKUZAWA, Shinobu) [JP/JP];
〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘2-1 山之内製薬
株式会社内 Ibaraki (JP). 渡辺 俊博 (WATANABE, Toshi-
hiro) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘2-1
山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP).(74) 代理人: 森田 拓 外 (MORITA, Hiroshi et al.); 〒
1748612 東京都板橋区蓮根三丁目17番1号 山之
内製薬株式会社 特許部内 Tokyo (JP).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ,
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,
IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).添付公開書類:
— 国際調査報告書2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: FLUORENE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: フルオレン誘導体

(57) Abstract: A novel fluorene characterized by having a fluorene skeleton to which a functional group such as a guanidino group is attached via a carbonyl group, or its salt. This compound has such an advantage as showing a high affinity particularly for 5-HT_{2B} receptor and 5-HT₇ receptor, among serotonin receptor subtypes, and exhibiting an excellent pharmacological effect compared with a conventional compound having an antagonistic activity to only one of the 5-HT_{2B} receptor and 5-HT₇ receptor. Thus, it is useful as a highly efficacious and safe preventive for migraine.(57) 要約: 本発明は、フルオレン骨格にカルボニル基を介してグアニジノ基等の官能基が結合した構造、に特徴を有する新規フルオレン誘導体又はその塩に関する。本発明化合物はセロトニン受容体のサブタイプの中でも特に5-HT_{2B}受容体及び5-HT₇受容体に親和性が高く、5-HT_{2B}受容体または5-HT₇受容体の拮抗活性を一方のみ有する従来化合物と比較して優れた薬理作用を示すという利点を有することから、効果に優れ安全性の高い片頭痛の予防薬として有用である。

WO 2005/080322 A1